

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局(43) 国際公開日  
2005年2月17日 (17.02.2005)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 2005/014610 A1(51) 国際特許分類<sup>7</sup>:  
19/20, C12Q 1/68, C12N 15/09

C07H 19/173,

下町 15-1-403 Kyoto (JP). 田中 一生 (TANAKA, Kazuo) [JP/JP]; 〒6048437 京都府京都市中京区西ノ京東中合町 56-9 08 Kyoto (JP).

(21) 国際出願番号: PCT/JP2004/011039

(22) 国際出願日: 2004年8月2日 (02.08.2004)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:  
特願2003-289972 2003年8月8日 (08.08.2003) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 独立行政法人科学技術振興機構 (JAPAN SCIENCE AND TECHNOLOGY AGENCY) [JP/JP]; 〒3320012 埼玉県川口市本町4丁目1番8号 Saitama (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 斎藤烈 (SAITO, Isao) [JP/JP]; 〒6078242 京都府京都市山科区勧修寺柒山1-21 Kyoto (JP). 岡本晃充 (OKAMOTO, Akimitsu) [JP/JP]; 〒6158077 京都府京都市西京区桂芝ノ

(74) 代理人: 佐伯憲生 (SAEKI, Norio); 〒1030027 東京都中央区日本橋三丁目15番8号 アミノ酸会館ビル4階 Tokyo (JP).

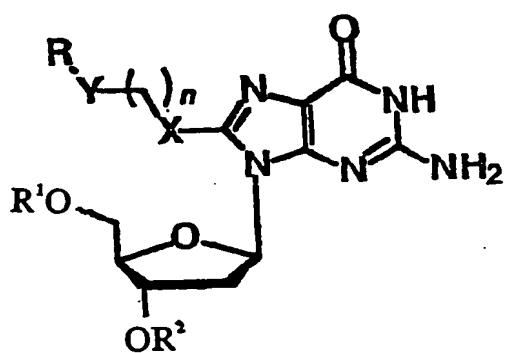
(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

[締葉有]

(54) Title: NUCLEOSIDE CAPABLE OF RELEASING FUNCTIONAL UNIT THROUGH OXIDATION AND PROCESS FOR PRODUCING OLIGONUCLEOTIDE CONTAINING THE SAME

(54) 発明の名称: 酸化により機能性ユニットを放出するヌクレオシドおよびそれを含むオリゴヌクレオチドの製造法



( I )

(57) Abstract: A method of easily releasing a useful substance bonded to oligonucleotide without impairing a target nucleic acid; and a novel base therefor. A nucleoside or nucleotide (oligonucleotide containing the same) represented by the formula: (I) (wherein each of X and Y independently represents -O-, -NH-, -N(alkyl)- or -S-; R represents a functional unit, a reporter unit or a biofunctional molecule; each of R<sup>1</sup> and R<sup>2</sup> independently represents a hydrogen atom, a phosphate bond group, a phosphoramidite group or a nucleotide; and n is a numeral of 1 to 10). There is further provided a method of

releasing the R group moiety at base portion by the use of the oligonucleotide comprising the nucleotide.

(57) 要約: 本発明は、オリゴヌクレオチドに結合している有用な物質を、標的の核酸を損傷させることなく、容易に放出させる方法、及びそのための新規な塩基を提供する。本発明は、次式 (I) 【化1】 (式中、X及びYはそれぞれ独立して-O-、-NH-、-N(アルキル)-、-S-を示し、Rは機能性ユニット、レポーターユニット、または生体機能分子を示し、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>はそれぞれ独立して、水素原子、リン酸結合基、ホスホロアミダイト基、ヌクレオチドを示し、nは1から10の数字を示す。) で表される、ヌクレオシド、又はヌクレオチドもしくはそれを含むオリゴヌクレオチド、並びに前記した本発明のヌクレオチドを含有してなるオリゴヌクレオチドを用いて、当該塩基部分におけるR基部分を放出させる方法に関する。



## 添付公開書類:

- 国際調査報告書
- 電子形式により別個に公開された明細書の配列表部  
分、請求に基づき国際事務局から入手可能

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。